

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN(11)Publication number : **09-110663**(43)Date of publication of application : **28.04.1997**

(51)Int.Cl.

A61K 7/16**B01J 13/00**(21)Application number : **07-297573**(71)Applicant : **LION CORP**(22)Date of filing : **20.10.1995**(72)Inventor : **HORIUCHI TERUO****(54) GEL CAPSULE BLENDED WITH OIL SOLUBLE COMPONENT, ITS PRODUCTION AND COMPOSITION FOR ORAL CAVITY****(57)Abstract:**

PROBLEM TO BE SOLVED: To enable to give good slow releasing effect of an oil soluble component by keeping the oil soluble component in good dispersivity and stability and well blending with various oral cavity components and obtain capsules stably blended with the oil soluble component.

SOLUTION: In this gel capsule blended with an oil soluble component, an inorganic or organic powdery carrier immersed or adhered with the oil soluble component is used as a core materia which is coated with a gel film of a water soluble high molecular weight material selected from an alginic acid salt, sulfated cellulose, carboxymethylcellulose, xanthane gum, gelan gum and hyaluronic acid.

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-110663

(43) 公開日 平成9年(1997)4月28日

(51) Int. Cl. ⁶	識別記号	片内整理番号	P I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/16			A 6 1 K 7/16	
B 0 1 J 13/00			B 0 1 J 13/00	F

審査請求 未請求 請求項の数 3 F D (全 6 頁)

(21) 出願番号 特願平7-297573

(22) 出願日 平成7年(1995)10月20日

(71) 出願人 000006769

ライオン株式会社

東京都墨田区本所1丁目3番7号

(72) 発明者 堀内 照夫

東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオ

ン株式会社内

(74) 代理人 弁理士 小島 隆司

(54) 【発明の名称】 油溶性成分配合ゲルカプセル、その製造方法及び口腔用組成物

(57) 【要約】

【解決手段】 油溶性成分が含まれ又は付着した無機又は有機粉粒状担体を芯材とし、これをアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質のゲル膜で被覆してなることを特徴とする油溶性成分配合ゲルカプセル。

【効果】 本発明の油溶性成分を配合したゲルカプセルは、油溶性成分を分散性良く、安定に保持したゲルカプセルであり、各種口腔用組成物に良好に配合されて良好な油溶性成分徐放効果を付与することができると共に、かかる油溶性成分を安定配合し得、かつ優れた保存安定性を与える。

(2)

特開平9-110663

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 油溶性成分が含浸又は付着した無機又は有機粉粒状担体を芯材とし、これをアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質のゲル膜で被覆してなることを特徴とする油溶性成分配合ゲルカプセル。

【請求項2】 油溶性成分を無機又は有機粉粒状担体に含浸又は付着させた後、これをアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質の水溶液に添加、分散して芯液を調製し、次いでこれをアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩を含有する凝固液に滴下することを特徴とする請求項1記載の油溶性成分配合ゲルカプセルの製造方法。

【請求項3】 請求項1記載の油溶性成分配合ゲルカプセルを配合してなる口腔用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、油溶性成分が安定に配合されたゲルカプセル及びこの油溶性成分配合ゲルカプセルの製造方法並びにこのゲルカプセルを配合してなる口腔用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術及び発明が解決しようとする課題】従来、芯材にアルギン酸塩水溶液、凝固剤に塩化カルシウム水溶液を用いてゲルカプセルを製造することはよく知られており、このようなゲルカプセルに水溶性薬剤を封入することは容易に行われる。しかし、脂溶性薬剤は、芯材水溶液に分散しないので、ゲルカプセルに封入することは困難である。この場合、脂溶性薬剤の水溶性を高めるため、芯材水溶液に界面活性剤を添加して脂溶性薬剤を乳化又は可溶化することが知られているが、界面活性剤を添加すると芯材のゲル化能に影響し、良好なゲルカプセルが調製できないものであった。

【0003】ところで、歯磨等の口腔用組成物には、香料や各種有効成分（薬剤）が配合される。これら香料及び有効成分の多くは油溶性であるが、従来より口腔用組成物においては、香料や有効成分の徐放性が望まれていると共に、特に配合安定性、保存安定性が望まれている。

【0004】本発明は上記事情に鑑みなされたもので、油溶性成分が安定に保持された油溶性成分配合ゲルカプセル及びその製造方法並びにこのゲルカプセルが配合された口腔用組成物を提供することを目的とする。

【0005】

2

ボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質の水溶液に添加、分散して芯液を調製し、これをアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩を含む凝固液に滴下することにより、油溶性成分を簡単かつ確実にゲルカプセル中に封入し得ると共に、このゲルカプセルは油溶性成分が安定に保持され、油溶性の香料や有効成分を油溶性成分としたゲルカプセルを歯磨等の口腔用組成物に配合した場合、香料や有効成分がゲルカプセル中に安定に保持されているので、口腔用組成物の他成分と混合した場合や口腔用組成物を長期間保存した場合などに失活し難く、配合安定性、保存安定性に優れていると共に、徐放性を与えることができることを知見し、本発明をなすに至った。

【0006】従って、本発明は、（1）油溶性成分が含浸又は付着した無機又は有機粉粒状担体を芯材とし、これをアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質のゲル膜で被覆してなることを特徴とする油溶性成分配合ゲルカプセル、（2）油溶性成分を無機又は有機粉粒状担体に含浸又は付着させた後、これをアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム及びヒアルロン酸から選ばれる水溶性高分子物質の水溶液に添加、分散して芯液を調製し、次いでこれをアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩を含有する凝固液に滴下することを特徴とする上記油溶性成分配合ゲルカプセルの製造方法、及び、（3）上記油溶性成分配合ゲルカプセルを配合してなる口腔用組成物を提供する。

【0007】以下、本発明につき更に詳述すると、本発明のゲルカプセルの製造に用いる油溶性成分は特に制限されないが、このゲルカプセルを口腔用組成物に用いる場合は、ローメントール、スペアミント油、ペパーミント油等の油溶性香料、ビタミンA、ビタミンE、ヒオゾール、トリクロサン等のビタミン類、殺菌剤、その他の油溶性有効成分（薬効成分）などが挙げられる。

【0008】本発明においては、これらの油溶性成分を無機又は有機粉粒状担体に含浸又は付着させて用いるが、かかる担体としては、水溶液中で網目構造を形成し、懸濁安定性、乳化安定性が良好なものが好ましい。

【0009】具体的に無機担体としては、シリカ等のケイ酸系、カオリナイト、ベントナイト、セリサイト等のアルミノケイ酸系、ペリクレース、マグネサイト、タルク等のマグネシウム系、炭酸カルシウム、石膏等の石灰質系、酸化バリウム、酸化錫、酸化チタン、酸化マグネ

(3)

特開平9-110663

3

4

ロビレン粉末、ポリビニル塩化粉末、ポリスチレン粉末等の合成品、部分アルファー化デンプン、クルミ粉末、アプリコット粉末、ミルクパウダー等の天然品を使用することができる。なお、これら担体の平均粒径は、5～20 μ m、特に10～15 μ mとすることが好ましい。

【0010】これらの担体に対する油溶性成分の含浸又は付着量は適宜選定されるが、通常担体100重量部に対して1～200重量部、特に1～100重量部である。

【0011】本発明のゲルカプセルは、上記油溶性成分を付着又は含浸させた担体を、アルギン酸ナトリウム等のアルギン酸塩、硫酸化セルロース、カルボキシメチルセルロース、キサンタンガム、ジェランガム、ヒアルロン酸から選ばれる1種又は2種以上の水溶性高分子物質を含有する水溶液に添加、分散し、芯液を得た後、これをアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩を含む凝固液に滴下する。

【0012】ここで、上記水溶性高分子物質の水溶液の濃度は、0.1～5%（重量%、以下同じ）、特に0.1～3%とすることが好ましい。また、この水溶性高分子物質水溶液に対する上記油溶性成分の含浸又は付着担体の添加量は、1～70%、好ましくは1～25%である。

【0013】一方、上記凝固液を得るためのアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩は適宜選定されるが、上記水溶性高分子物質の種類に応じて選択使用することが好ましい。例えば、使用する高分子物質がアルギン酸ナトリウムの場合にはカルシウム系、硫酸化セルロースにはナトリウム系、カルボキシメチルセルロースにはリチウム、ナトリウム、カリウム、セシウム、マグネシウム、カルシウム系、キサンタンガムにはナトリウム系、ジェランガムにはナトリウム、カルシウム、マグネシウム系、ヒアルロン酸にはナトリウム系の凝固剤を使用することができる。なお、これらアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水溶性塩の水溶液（凝固液）濃度は、0.1～25%、特に1～20%とすることが好ましい。

【0014】上記のように凝固液中に上記芯液を滴下することにより、芯液中の水溶性高分子物質がゲル化し、上記芯材（油溶性成分が含浸又は付着した担体）をこの水溶性高分子物質のゲル膜が被覆するもので、これによ

って本発明のゲルカプセルが得られるが、本発明のゲルカプセルは油溶性成分がカプセル中に安定に保持されていると共に、徐放性を有するので、種々の用途に使用され、特に口腔用組成物、例えば歯磨類、洗口剤などや、トローチ、チューインガム、更に各種化粧料などに配合することができる。とりわけ洗口剤等の水性製剤に好適に用いられる。なお、本発明のゲルカプセルが配合される口腔用組成物等の製剤の処方は公知の処方とすることができる。

【0015】

【発明の効果】本発明の油溶性成分を配合したゲルカプセルは、油溶性成分を分散性良く、安定に保持したゲルカプセルであり、各種口腔用組成物に良好に配合されて良好な油溶性成分徐放効果を付与することができると共に、かかる油溶性成分を安定配合し得、かつ優れた保存安定性を与える。また、本発明のゲルカプセルの製造方法によれば、上述した油溶性成分を保持した優れたゲルカプセルを簡単かつ確実を得ることができる。

【0016】

【実施例】以下、実施例及び配合例を示し、本発明を具体的に説明するが、本発明は下記実施例に制限されるものでない。

【0017】【実施例1】1-メントール10g、結晶セルロース粉末10gを共に乳鉢に入れ、良く混合した後、1%アルギン酸ソーダ水溶液80g中に添加し、良く攪拌した。この溶液を20%塩化カルシウム水溶液100gに滴下し、凝固させて、濾過、水洗後、ゲルカプセルを得、調整したゲルカプセルを水中に入れて保存した。

【0018】【実施例2】結晶セルロース粉末の代わりにリン酸カルシウム10gを使用した以外は、実施例1と同様の方法でゲルカプセルを調製した。

【0019】上記ゲルカプセルは、1-メントールの放出量が初期にかなり多く、時間の経過と共に急激に低下するようなことなく、経時的にほぼ同じで、良好な徐放効果を有しているものであり、これは担体（結晶セルロース粉末、リン酸カルシウム）に油溶性成分（1-メントール）が均一に担持され、それを水溶性高分子物質（アルギン酸ソーダ）のゲル膜が被覆しているためと考えられた。

【0020】次に、ゲルカプセルの配合例を示す。

【配合例1】洗口剤

エタノール	10.0 %
グリセリン（85%）	10.0
プロピレングリコール	2.0
クエン酸	3.0

(4)

特開平9-110663

5	6
サッカリンナトリウム	0.1
安息香酸ナトリウム	0.2
香料	0.7
ゲルカプセル(実施例1)	2.0
色素	微量
精製水	バランス
計	100.0

【0021】

〔配合例2〕洗口剤

エタノール	1.0 %
ソルビット(60%)	7.5
グリセリン(85%)	7.5
プロピレングリコール	1.5
カルボキシメチルセルロース	0.4
ポリソルベート(80)	1.5
クエン酸	2.5
クエン酸ナトリウム	5.0
グリチルリチン酸ジカリウム	0.05
トラネキサム酸	0.05
ステビアエキス	0.1
ゲルカプセル(実施例2)	2.0
香料	0.3
精製水	バランス
計	100.0

【0022】

〔配合例3〕洗口剤

エタノール	10.0 %
グリセリン(85%)	10.0
プロピレングリコール	2.0
アルギン酸ナトリウム	0.2
ヒドロキシエチルセルロース	0.3
リン酸1水素ナトリウム	3.0
リン酸2水素ナトリウム	6.0
ポリ(オキシエチレン)(20)セチルエーテル	2.0
炭酸水素ナトリウム	3.0
サッカリンナトリウム	0.1
安息香酸ナトリウム	0.2
ゲルカプセル(実施例1)	2.0
色素	微量
精製水	バランス
計	100.0

【0023】

〔配合例4〕洗口剤

エタノール	1.0 %
ソルビット(60%)	7.5
グリセリン(85%)	7.5

(5)

特開平9-110663

7	8
リン酸2水素ナトリウム	2.5
トリクロサン	0.1
ステビアエキス	0.1
ゲルカプセル(実施例1)	2.0
香料	0.3
精製水	バランス
計	100.0

【0024】

【配合例5】洗口剤

エタノール	10.0 %
ソルビット(60%)	10.0
プロピレングリコール	1.5
カルボキシメチルセルロース	0.4
クエン酸	2.5
クエン酸ナトリウム	5.0
塩化セチルピリジニウム	0.05
ステビアエキス	0.1
ゲルカプセル(実施例1)	2.0
香料	0.3
精製水	バランス
計	100.0

【0025】

【配合例6】液状歯磨

沈降性シリカ	20.0 %
キサンタンガム	0.25
ポリアクリル酸ナトリウム	0.25
プロピレングリコール	2.0
ソルビット	30.0
グリセリン	10.0
塩化ベンゼトニウム	0.05
ポリ(オキシエチレン)(10)オレイルエーテル	1.0
サッカリンナトリウム	0.1
ゲルカプセル(実施例1)	2.0
香料	1.0
精製水	バランス
計	100.0

【0026】

【配合例7】液状歯磨

炭酸水素ナトリウム	0.3 %
沈降性シリカ	20.0
キサンタンガム	0.15
ポリアクリル酸ナトリウム	0.2
プロピレングリコール	2.0
グリセリン	20.0
ソルビット	50.0
サッカリン	0.1

(6)

特開平9-110663

		9	10
		香料	1.0
		精製水	バランス
		計	100.0
【0027】			
〔配合例8〕トローチ			
アラビアゴム		6.0	%
ブドウ糖		72.0	
モノフルオロリン酸ナトリウム		0.05	
リン酸1カリウム		0.1	
リン酸2カリウム		0.2	
ゲルカプセル（実施例1）		2.0	
香料		1.0	
精製水		バランス	
計		100.0	
【0028】			
〔配合例9〕チューインガム			
ガムベース		20.0	%
炭酸カルシウム		2.0	
水アメ		15.0	
飴糖		58.0	
リン酸1カリウム		0.4	
リン酸2ナトリウム		0.5	
ゲルカプセル（実施例1）		2.0	
香料		1.0	
精製水		バランス	
計		100.0	